

# Eng. translation of JP11199465 (Machine)

Application master item reference

Page 1 of 3

## Disclaimer:

The English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the INPI, and the users, named via document in the original language are not responsible for the result of the translation.

## Notes:

1. Untranslatable words are indicated with asterisks (\*\*\*)
2. Terms in the figures are not translated and shown as it is.

Translated:06/16/2008 05/19/2008

Dictionary: Last updated 04/01/2006 (Phenyl-1,3-butanediol; 2,3-butanediol; Phenylbutanediol; 1,3-Butanediol)

## Application data and Transaction history

Application (1) ( 10-013207) (10.01.07)

Applicant's or Attorney's Reference (PS09-21)

Kind of Application(01)

New Law

Publication (KOKAI) ( 11-199465) (11.07.27)

Reference Date (10.01.07)

Internal Priority (0)

Examined Publication (KOKOKU)/Granted Patent ( ) ( )

Claim of Priority ( )

Other Previous Applications

Trial/Appeal ( ) ( ) ( )

Examiner ( ) ( )

Registration ( ) ( )

Number of Oppositions ( 0)

Number of Claims ( 4)

Application Fee( 21,000)

Decision of Examined Publication (KOKOKU) (Date of Drafting ) (Examiner )

Reference ( )

Exceptions to Lack of Novelty (0)

Deposition of Microorganisms (0)

Antipollution Technology ( )

Final Decision ( ) (Date of Drafting ) (Examiner )

Reconsideration by Examiner before Appeal ( )

Transfer to Appeal( )  
Public Order / Abstract(0)

(Dispatch of Final Decision ) (Notice through Gazette )  
Request to Examination( 0- )  
No Request(0)  
Automatic Printout( )

Final Disposal (A09) (17.04.26)  
Preparation for Publication (1)  
Accelerated Examination ( )

Conversion of Application ( ) ( ) ( )  
Appeal/Trial Decision ( ) ( )

Original Application( ) ( ) ( )  
Kind( )

Extension of Term ( )  
Date of Latest Action( )

Publication of Japanese Translation ( ) ( )  
Submission of Translation ( )  
International Application( )

Domestic Re-publication ( )  
International Publication ( )

IPC for Unexamined Publication: A61K 7/48 FN  
IPC for Assignment:  
IPC for Examined Publication:

Title of Invention  
Skin external preparations  
Applicant(s)  
Representative( ) kind(2) Code(592262543) Country/Prefecture(23)  
Japan MENADO cosmetics incorporated company

**Disclaimer:**

The English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the (NPI), and those who stated that disclaimer in the original language are not responsible for the result of the translation.

**Notes:**

1. Untranslatable words are replaced with question (\*\*).
2. Figures in the figures are untranslatable and shown as Fig.

Translated: 00:03:09 JST 05/19/2008

Dictionary: Last updated 04/17/2016. Priority: 1. Biotechnology / 2. Medicine/Pharmaceutical industry / 3. Chemistry

[Document Name] Description

[Title of the Invention] Skin external preparations

[Claim(s):

[Claim 1] Skin external preparations characterized by blending tocopheryl phosphoric ester and/or its salts, and blending the polyalcohol, acid, and/or its salts.

[Claim 2] It is characterized by blending a surface-active agent.

[Claim 1] \*\*\*\*\* external preparations.

[Claim 3] The loadings of tocopheryl phosphoric ester and/or its salts, acid, and/or salts are characterized by being 0.01 to 20%, and 0.01 to 30%, respectively.

[Claim 1] \*\*\*\*\* external preparations.

[Claim 4] It is characterized by tocopheryl phosphoric ester and/or its salts being sodium salt or disodium salt, the polyalcohol's being propylene glycol, and acid and/or its salts being potassium salt of phosphoric acid, ascorbic acid, or its inductor.

[Claim 1] or

[Claim 3] \*\*\*\*\* external preparations.

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Industrial Application] This invention relates to the skin external preparations characterized by blending tocopheryl phosphoric ester and/or its salts stably.

[0002]

[Description of the Prior Art] The tocopherol is widely recognized as vitamin E, has physiological activity, such as high antioxidant ability and a circulation promotion operation, and is blended with a drug, cosmetics, feed, etc, for many years. Moreover, the physiological activity beyond it has been shown [ equivalent to a tocopherol, or ] by tocopheryl phosphoric ester which is the inductor, and/or its salts by being metabolized in a living body, and it seems that the utility value continues to become large.

[0003]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] However, conventionally, although tocopheryl phosphoric ester and/or its salts showed high water solubility as compared with the tocopherol, they were very difficult to cause coagulation sedimentation etc., when blending with solution or an emulsification system, and to blend stably. This invention solves such a technical problem and it aims at offering a constituent with high stability and safety.

[0004]

[Means for Solving the Problem] As a result of inquiring to many of these problems, this invention persons find out the means which can blend tocopheryl phosphoric ester and/or its salts with a solution system or an emulsification system stably, and came to complete this invention.

[0005] Namely, by blending tocopheryl phosphoric ester and/or its salts with the same system as the polyalcohol, acid of a certain kind, and/or its salts in a solution system or an emulsification system. It made it possible to blend tocopheryl phosphoric ester and/or its salts stably. Moreover, in the emulsification system using the inside of solution, and a surface-active agent with high safety, if the skin external preparations which used together tocopheryl phosphoric ester and/or its salts are prepared, the high tablet of safety can be obtained.

[0006] Although the anything of the tocopheryl phosphoric ester used by this invention and/or its salts is good, monoester and salt have preferably good metal salt, such as sodium salt, disodium salt, potassium salt, and dipotassium salt. Although the loadings in particular of tocopheryl phosphoric ester and/or its salts are not limited, its 0.01 to 20 weight % is desirable. It is 0.01 to 5.0 weight %, still more preferably. At 0.01 or less weight %, the manifestation of an effect is scarce, and an anxiety is in the stability on a tablet at 20 weight % or more.

[0007] [ the polyalcohol used by this invention is / anything / good if it can be used as skin external preparations, but ] Dipropylene glycols including propylene glycol, polypropylene glycol, 1, 3-butylen glycol, glycerin, diglycerin, polyglycerin, a polyethylene glycol, etc. are raised. It is propylene glycol still more preferably. Although the loadings in particular of the polyalcohol are not limited, they can be adapted in 0.01 to 99 weight % of a large area.

[0008] If the acid used by this invention and/or its salts can be used as skin external preparations, although it is good, anything preferably Citric acid, citrate, phosphoric acid, an orthophosphate, a glycyrrhizinic acid, glycyrrhizin acid chloride, succinic acid, the succinate, a fumaric acid, fumaric acid chloride, ascorbic acid phosphoric acid, an ascorbic acid orthophosphate, etc. are desirable. As a kind of the salt, metal salt, such as sodium salt, disodium salt, potassium salt, dipotassium salt, and magnesium salt, is still more desirable. Although the loadings in particular of these acid and/or the salts of those are not limited, its 0.01 to 30 weight % is desirable. It is 0.05 to 10 weight % still more preferably. At 0.01 or less

weight %, the manifestation of an effect is scarce, and an anxiety is in the stability on a tablet at 30 weight % or more.

[0009] If tocopheryl phosphoric ester and/or its salts are used for the same system as the polyalcohol and acid, and/or its salts, stability with the passage of time will become still better.

[0010] Moreover, it can use for face toilet, an emulsion, cream, ointment, etc. in the range which does not spoil the effect of this invention to the skin external preparations of this invention. If the skin external-preparations constituent of this invention is an ingredient generally used for skin external preparations besides the above-mentioned essential ingredient, it is [ anything ] good. As a main composition ingredient, it consists of a surface-active agent, oily matter, and/or an aquosity substance.

[0011] A surface-active agent is raised as one of the skin external-preparations constituents of this invention. [ the surfactant which can be used combining this invention ] It is the substance which has a canal part, and a hydrophilic part in a monad, and, specifically, a nonionic surfactant, an anionic surface-active agent, a cationic surface-active agent, an amphotolytic surfactant, an amphiphilic agent, etc. which are usually used for the emulsified type cosmetic are mentioned.

[0012] As a nonionic interface active agent, for example Mono-oleic acid sorbitan, Mono-isostearic acid sorbitan, mono-lauric acid sorbitan, mono-palmitic acid sorbitan, Monostearin acid sorbitan, sorbitan sesquioleate, triolein acid sorbitan, \*\*\*\*\*- 2-ethylhexyl acid JIGURISE roll sorbitan and tetra-2- Sorbitan fatty acid esters, such as ethylhexyl acid JIGURISE roll sorbitan; Monostearin acid glyceryl palm-oil-fatty-acid glyceryl, Glycerine fatty acid esters, such as oleic acid glyceryl and distearic acid glyceryl, Mono-oleic acid diglyceryl, monoisostearate diglyceryl, Monostearin acid decaglyceryl, mono-oleic acid decaglyceryl, Polyglyceryl fatty acid ester, such as monostearin acid hexa glyceryl; Propylene glycol fatty acid ester, such as monostearin acid propylene glycol; A stearic acid methyl glucoside, a stearic acid ethyl glucoside, a stearic acid propyl glucoside, Fatty acid alkyl glucoside, such as an oleic acid methyl glucoside; Hydrogenated-castor-oil inductor; Glycerin alkyl ether; POE sorbitan monooleate, POE-sorbitan monostearate, POE-sorbitan mono-oleate, POE sorbitan fatty acid esters, such as POE-sorbitan tetra-oleate; POE-sorbit mono-laurate, POE-sorbit monooleate.

POE-sorbit PENTA oleate, POE sorbit fatty acid ester, such as POE-sorbit monostearate; POE-glycerol monostearate, POE glycerine fatty acid esters, such as POE-glycerin monostearate and POE-glycerin bird isostearate; POE monooleate, POE fatty acid ester, such as POE distearate, POE monodioleate, and distearic acid ethylene glycol; POE lauryl ether, POE alkyl ether, such as POE oleyl ether, POE stearyl ether, POE behenyl ether, POE2-octyldecyl ether, and POE cholestanol ether; POE octyl phenyl ether, POE alkylphenyl ether, such as POE nonylphenyl ether and POE dinonylphenyl ether; Pluronic types, such as block polymerization of POE-POP; POE-POP Septoliles ether, POE-POP2-decyl tetradecyl ether, POE-POP monobutyl ether, POE-POP alkyl ether, such as POE-POP lanolin and POE-POP glycerin ether; Tetra-POE and tetra-POP ethylenediamine condensation products, such as a TETORO nickel; POE castor oil, POE hydrogenated castor oil, POE hydrogenated-castor-oil monoisostearate, POE hydrogenated-castor-oil bird isostearate, POE hydrogenated-castor-oil mono-pyroglutamic acid mono-isostearic acid diester, POE castor oil hydrogenated-castor-oil inductors, such as a POE hydrogenated-castor-oil maleic acid; POE yellow-bees-wax lanolin inductors, such as POE sorbit yellow bees wax; Palm-oil-fatty-acid diethanolamide, Alkanol amide, such as lauric acid monoethanolamide and fatty-acid isopropanol amide; POE propylene glycol fatty acid ester; POE alkylamine; POE fatty acid amide; Sucrose monostearate Sucrose fatty acid ester, such as sucrose distearate and sucrose tristearate; POE nonylphenyl formaldehyde condensation product; Alkyl ethoxy dimethyl amine oxide; Bird oleyl phosphoric acid; Polyether denaturation silicone, Silicone system surface-active agents, such as alcholic denaturation silicone and amino denaturation silicone, etc. are mentioned.

[0013] As anionic surfactant, for example The foundation for soapsoap, lauric acid sodium, Palmitic acid sodium, lauric acid potassium, myristic acid potassium, Fatty acid soapsoap, such as palmitic acid potassium and stearic acid potassium; Sodium lauryl sulfate, High-class alkyl-sulfuric-acid ester salt, such as lauryl potassium sulfate; Cholic acid sodium, Bile salt, such as a sodium deoxycholate; Stearoyl sodium lactate, Acyl lactates, such as iso stearoyl sodium lactate; Alkyl POE lauryl sulfuric acid triethanolamine, Alkyl ether sulfuric ester salt, such as a POE sodium lauryl sulfate; N-acyl sarcosine acid, such as lauroyl sarcosine sodium; N-myristoyl N-methyl laurine sodium, Higher fatty acid amidosulfonic acid salt, such as palm-oil-fatty-acid MECHIRUTAU iod sodium and lauryl MECHIRUTAU iod sodium; POE oleyl ether sodium phosphate, Phosphate, such as POE stearyl ether phosphoric acid; G 2-ethylhexyl sulfo sodium succinate, monolauroylmonoethanol amide polyoxyethylene sulfosodium succinate, Sulfo succinate, such as lauryl polypropylene glycol sulfo sodium succinate; Linear sodium dodecylbenzenesulfonate, Alkylbenzenesulfonate, such as linear

dodecylbenzenesulfonic acid triethanolamine and linear dodecylbenzenesulfonic acid; N-lauroyl monosodium glutamate, N-stearoyl glutamic-acid disodium; N-acyl glutamate, such as N-myristoyl L-glutamic acid monosodium; Higher fatty acid ester sulfate ester salt, such as hardening palm-oil-fatty-acid glycerin sodium sulfate; Sulfated oil, such as turkey red oil; POE alkyl ether carboxylic acid; POE alkyl allyl ether carboxylate salt; alpha olefin sulfonate; Higher fatty acid ester sulfonate; Second class alcoholic sulfuric ester salt; Higher fatty acid ARUKI roll amidesulphuric acid ester salt; Lauroyl monoethanolamide sodium succinate; N-palmitoyl aspartic acid JITOPI ethanolamine; Sodium caseinate; silicone system surface-active agents, such as sulfonic-acid-denaturalization silicone, etc. are mentioned.

[0014] As a cationic surfactant, for example Stearyl chloride trimethylammonium, Alkyl trimethylammonium salt, such as chlorination lauryl trimethylammonium; Dialkyl dimethylammonium salt, such as chlorination diisostearyltrimethylbenzylammonium; Chlorination Pori (the N, and N'-dimethyl 3, 5-methylene piperidinium), alkyl pyridinium salt, such as cetylpyridinium chloride; alkyl quaternary ammonium salt; Alkyldimethyl benzylammonium salt; Alkyl iso quinolinium salt; Dialkyl MÖRIHONIUM salt; POE alkylamine; Alkylamine salt; Polyamine fatty acid inductor; Amyl alcohol fatty acid inductor; Benzalkonium chloride; It is benzethonium chloride etc.

[0015] As an amphoteric surfactant, for example alkyl glycine salt; Carboxymethyl glycine salt; N-acylamino ethyl N-2-hydroxyethyl glycine salt; alkyl PORIAMINOPORI carboxy glycine salt; alkylamino propionate; -- alkyl imino dipropionic acid salt; N-acylamino ethyl N-2-hydroxy ECHIRUPI Ropion acid chloride; Alkyl dimethylamino acetic acid betaine; Fatty acid amide propyl dimethylamino acetic acid betaine; alkyl dihydroxy ethylamino acetic acid betaine; N-alkyl N, N-dimethylammonium N-propyl sulfonate; N-alkyl N, N-dimethylammonium N-(2-hydroxypropyl) sulfonate; N-fatty acid amide propyl N, N-dimethylammonium N-(2-hydroxypropyl) Sulfonate etc. is mentioned.

[0016] An amphiphilic agent points out into a monad the substance which has a nonpolar group and a polar group, and a general nonionic interface active agent and ionic surfactant are what is distinguished and classified. For example, a lauric acid, a myristic acid, a palmitic acid, stearic acid, BEHEN (BEHENIN) acid, oleic acid, 12-hydroxy stearic acid, Undecylenic acid, toric acid, isostearic acid, linoleic acid, Reno Laing acid, Higher fatty acids, such as eicosapentaenoic acid (EPA) and docosa-hexaenoic acid (DHA); Lauryl alcohol, A cetyl

alcohol, a stearyl alcohol, behenyl alcohol, myristyl alcohol, Straight chain alcohol, such as oleyl alcohol and behenyl alcohol; Mono-stearyl glycerin ether (balyi alcohol), 2-DESHIRUTETORADESHINORU, lanolin alcohol, cholesterol, A phytosterol, hexyl dodecanoate, isostearyl alcohol, compound which has a high-class fatty alcohol monoglyceride, glycerol monoalkyl ether, monoalkyl amine, and sterol frames, such as branched chain alcohol, such as octyl dodecanoate; (cholesterol -) phytosterol diacyl ester type glycerophospholipid; (phosphatidylcholine -) Phosphatidylethanolamine, phosphatidylinositol, phosphatidylserine, phosphatidic acid, phosphatidylglycerol, phosphatidylserines, etc. these hydrogenation things, and hydroxide mono-acyl ester type glycerophospholipid; (lysophosphatidylcholine -) Lysophosphatidylethanolamine, lysophosphatidylinositol, etc. and these hydrogenation things; Plasmalogen; Sphingomyelin; Glycolipids (galactosylceramide; a glucoseylceramide, a sulfatide, ganglioside, etc.); There is saponin etc.

[0017] As oily matter used for the skin external preparations of this invention if it is well-known oily matter for skin makeup, such as oil and fats, lows, a hydrocarbon oil, ester, silicone oil, fluoro silicone oil, and a perfluoro-polyether oil. What kind of thing may be used; for example, as liquid oil and fats An avocado oil, camellia oil, a turtle oil, a macadamia-nuts oil, the corn oil, A mink oil, olive oil, the rapeseed oil, yolk oil, sesame oil, a par chic oil, There are a wheat germ oil, a sasanqua oil, castor oil, the linseed oil, safflower oil, cottonseed oil, perilla oil, soybean oil, peanut oil, tea seed oil, kaya oil, rice bran oil, the China Gili oil, Japanese tung oil, jojoba oil, germ oil, triglycerol, glyceryl trioleate, bird iso palmitic acid glycerin, etc. As solid oil and fats, there are cacao oil, palm oil, horse fat, hardening palm oil, palm oil, beef tallow, mutton tallow, hardening beef tallow, palm seed oil, lard, beef bené fat, Japan wax kernel oil, hydrogenated oil, neat's foot lipid, Japan wax, hydrogenated castor oil, etc. As lows, yellow bees wax, candelilla wax, a cotton low, a carnauba wax, There are a bay berry low, two Tallow, spermaceti wax, montan wax, bran wax, lanolin, kapok low, acetic acid lanolin, liquefied lanolin, and sugarcane low, lanolin fatty acid isopropyl, the lauric acid hexyl, reduction lanolin, jojoba wax, hard lanolin, a shellac low, etc. As a hydrocarbon oil, there are liquid paraffin, the ozokerite, squalane, pristane, a paraffin, ceresin, squalene, petroatum, microcrystalline wax, etc. As synthetic ester oil, myristic acid isopropyl, octanoic acid Sept Iles, Myristic acid octyldodecyi, palmitic acid isopropyl, butyl stearate, The lauric acid hexyl, myristic acid Millis Chill, oleic acid DESHIRU, Dimethyl octanoic acid hexyldecyl, lactic acid Sept Iles, lactic acid Millis Chill, Acetic acid lanolin, stearic acid isocetyl, isostearic acid isocetyl, Hydroxy stearic acid cholestryl, G 2 - Ethylhexyl acid ethylene glycol, Dipentaerythritol fatty acid ester, a mono-isostearic acid N-alkyl glycol, Neopentylglycol dicaprate, malate diisostearyl, G 2 - Heptyl undecanoic acid glycerin, tree 2 - Ethylhexanoic acid trimethylolpropane, Birc isostearic

acid trimethylolpropane and tetra-2-Ethylhexanoic acid pentane erythritol, The bird 2-ethylhexanoic acid glyceryl, bird isostearic acid trimethylolpropane, cetyl-2-ethylhexanoate, 2-ethylhexyl palmitate, trimyristin acid glycerin, tree 2-Heptyl undecanoic acid glyceride, castor oil fatty acid methyl ester Oleic acid oil, the cetostearyl alcohol, aceto glyceride, Palmitic acid 2-heptyl undecyl, diisobutyl adipate, N-lauroyl-L-glutamic acid 2-octyldecyl ester, Adipic acid G 2-Heptyl undecyl, ethyl laurate, di-2-ethylhexyl sebacate, There are myristic acid 2-hexyldecyl, palmitic acid 2-hexyldecyl, adipic acid 2-hexyldecyl, sebacic acid diisopropyl, succinic acid 2-ethylhexyl, ethyl acetate, butyl acetate, amyl acetate, triethyl citrate, etc. As silicone oil, for example Dimethylpolysiloxane, methylphenyl polysiloxane, Chain-like polysiloxanes, such as methyl hydrogen polysiloxane; Decamethyl polysiloxane, Annular polysiloxanes, such as a dodeca methylpolysiloxane and tetramethyl tetrahydrogen polysiloxane; Silicone resine, silicone rubber, etc. which form the three-dimension anastomosis are mentioned as an oil.

[0018] As an aquosity substance used for the skin external preparations of this invention, it is the range which does not lose the effect of this invention, and the various materials usually used for a cosmetic can be used. For example, there are ethanol, propanol, isopropanol, etc. as lower alcohol. The polyalcohol used in order to lower the interfacial tension of the aqueous phase as a moisturizer again has a polyethylene glycol, propylene glycol, dipropylene glycol, 1, 3-butylene glycol, hexylene glycol, glycerin, diglycerine, etc. As a moisturizer, in addition, a sorbitol, xylitol, maltitol, a maltose, There are D-mannitol, erythritol, a trehalose, water American, grape sugar, fruit sugar, milk sugar, sodium chondroitin sulfate, hyaluronate sodium, adenosine phosphate sodium, sodium lactate, pyrrolidone carboxylate salt, a glucosamine, cyclodextrin, etc. As a water soluble polymer, gum arabic, tragacanth, galactan, Carob gum, Cyamopsis Gum, karaya gum, caragheenan, pectin, agar, quince seed (quince), and a starch (rice and corn -) Vegetable system polymers, such as a potato, wheat, ARUGÉ, colloid (fucus extract), and locust bean gum; Xanthan gum, Microbe system polymers, such as gellant gum, a dextran, a SAKUSHINO glucan, and a pullulan; Collagen, Animal system polymers, such as casein, albumin, and gelatin; Carboxymethyl starch, Starch system polymers, such as a methyl hydroxypropyl starch; Methycellulose. The nitrocellulose, the ethylcellulose, methyl hydroxypropylcellulose, Hydroxyethyl cellulose, cellulose sodium sulfate, hydroxypropylcellulose, Cellulose system polymers in carboxymethylcellulose sodium, a crystalline cellulose, the end of a cellulose, etc.; Alginic acid system polymers, such as sodium arginine and propylene glycol alginate; Polyvinyl methyl ether, Vinyl system polymers, such as a carboxyvinyl polymer; Polyoxyethylene system polymer; Polyoxyethylene polyoxypropylene copolymer system polymer; Sodium polyacrylate, Acrylic polymers, such as polyethylacrylate

and polyacrylamide; Polyethyleneimine; Cation polymer; There are inorganic system water soluble polymers, such as a bentonite, magnesium aluminum silicate, RAPONAITO, hectorite, and a silicic acid anhydride, etc. As a medicine (the mold of salt of an isolation thing, acid, or a base and an ester type are also included) Vitamin A oil, a retinol, retinol palmitate, retinoic acetate, Inositol, a pyridoxine hydrochloride, the nicotinic acid benzyl, a nicotinamide, Nicotinic acid Di-alpha - A tocopherol, ascorbic acid magnesium phosphate, Vitamin D2 (ergocalciferol) Vitamin D3 di - alpha - Tocopherol, Acetic acid di - alpha - Vitamins, such as a tocopherol, pantothenic acid, and a biotin. Hormone, such as estradiol and ethynodiol, arginine, Aspartic acid, a cystine, cysteine, a methionine, a serine, a leucine, Pit inflammation agents, such as amino acid, such as a tryptophan, allantoin, glycyrrhetic acid, and azulene, There are refrigerants, such as astringents, such as whitening agents, such as arbutin, ascorbic acid magnesium, and sodium ascorbate, a zinc oxide, tannic acid, and aluminum potassium sulfate, L-menthol, and camphor, sulfur, lysozyme chloride, a pyridoxine hydrochloride, gamma-oryzanol, etc. As various kinds of extract, *Houttuynia* extractives, cork tree bark extractives, melilot extract, A *Lamium album* var. *barbatum* extract, *glycyrrhiza* extract, peony extractives, soapwort extractives, *HECHIMAEKISU*, *chinae*-*corex* extractives, creeping saxifrage extractives, the *Sophora angustifolia* extractives, *Nuphar japonicum* extract, Fennel extractives, primrose extractives, rose extractives, *JIOUEKISU*, Lemon extract, *lithospermum* radix extractives, an aloe extract, calamus extractives, eucalyptus extractives, A field horsetail extract, sage extractives, thyme extractives, tea extractives, seaweed extractives, There are *cus B. platyphylla* Sukatchev var. *japonica* *Hara* extractives, clove extractives, bramble extractives, the *melissa* extractives, carrol extractives, the Carrots extractives, horse chestnut extractives, peach extractives, a peach leaves extract, mulberry extractives, *YAGURIMAGIKU* extractives, *hamamelis* extract, placental extract, a \*\*\*\* extractant, silk extract, etc. In addition, preservatives, such as benzoate, a paraoxybenzoic acid, a salicylic acid, and phenoxyethanol, Antioxidants, such as alpha-tocopherol and a dibutyl hydroxy lotusne, Alanine, edelic acid sodium salt, sodium polyphosphate, sodium metaphosphate, Chelating agents, such as phosphoric acid, a benzoic acid system ultraviolet ray absorbent, an arthranilic acid system ultraviolet ray absorbent, A salicylic acid system ultraviolet ray absorbent, a cinamic acid system ultraviolet ray absorbent, a benzophenone system ultraviolet ray absorbent, Urocanic, urocanic ethyl, 2-phenyl 5 - Methylbenzoxanedi, 2 - (2'- hydroxy5'-methylphenyl) Benzotriazol, 4-tert - Ultraviolet ray absorbents, such as butyl 4'-methoxydibenzoylmethane, 2-amino 2 - Methyl 1 - Propanol, 2-amino 2 - Methyl 1 and 3 - Propanediol, A potassium hydroxide, sodium hydroxide, the triethanolamine, the sodium carbonate, Lactic acid, citric acid, a glycolic acid, succinic acid, tartaric acid, dl - PH adjusters, such as malic acids and these salt, potassium carbonate, sodium bicarbonate, and an ammonium bicarbonate, a filler, a color pigment, \*\*\*\* paints, organic powder, hydrophobing processing powder, Hydrophilization treatment powder,

tar dye, an oily gelling agent, spice, a fungicide, etc. can be used. These may be used independently, respectively, and two or more sorts may be combined and they may be used. Moreover, well-known ingredients, such as not only the above-mentioned ingredient but mineral, an animal and vegetable extract, pigments, spice, powder, etc. which are usually used for skin external preparations, can be blended also about other combination ingredients.

(0019)

[Working example] Although a work example explains this invention in detail, this invention is not limited to a work example. The loadings in a work example are weight %.

(0020) Example 1 lotion 1 comparative example 1 Work example 1 Work example 2 Work example 31 [ tocopheryl sodium phosphate ] 2.00 2.00 2.00 2.002 Propylene Glycol - 6.00 - 6.003 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl 0.20 0.20 0.20 0.204 Ethanol 5.00 5.00 0.05 0.055 Spice 0.05 0.05 0.05 0.056 Potassium Phosphate - - 5.00 5.007 Purified water 92.75 86.75 87.75 81.75 (manufacture procedure) 1-5 and 6-- The distributed dissolution of 7 is carried out respectively at homogeneity, and it adds, agitating 1-5 to 6-7, and the target lotion 1 is obtained. Stability with the passage of time (Result) Comparative example 1 Work example 1 Work example 2 340 degrees C (one month) of work examples x O O O O degrees C (one month) x O O O freezing (three ordinary temperature return) x O O O O: -- O: excellent in especially stability - x: excellent in stability -- in the lotion 1 with bad stability, the work example 1, the work example 2, and the work example 3 were excellent in transparency, and showed good stability with the passage of time. Especially the work example 3 was excellent in temporal stability also in it. On the other hand, in the comparative example 1, it could not dissolve or distribute uniformly, and the lotion excellent in transparency was not able to be obtained.

(0021) Example 2 [ lotion 2 component name ] A comparative example 2 Work example 41 Tocopheryl sodium phosphate 5.00 5.002 Glycerin - 20.003 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl 0.20 0.204 Disodium Hydrogenphosphate - 3.005 Purified water 94.80 The distributed dissolution of 71.80 (manufacture procedure) 1-3, and 4-5 is carried out respectively at homogeneity, and it adds, agitating 1-3 to 4-5, and the target lotion 2 is obtained. (Result) The lotion 2 obtained in the work example 4 was excellent in transparency, and showed good

stability with the passage of time. On the other hand, in the comparative example 2, it could not dissolve or distribute uniformly, but floating of the oil droplet was checked, and the lotion excellent in transparency was not able to be obtained.

[0022] Example 3 [ lotion 3 component name ] A comparative example 3 Work example 5  
Tocopheryl potassium phosphate 0.50 0.502 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl 0.20 0.203  
Spice 0.05 0.054 Disodium Hydrogenphosphate - 1.005 Purified water 99.25 The distributed dissolution of 98.25(manufacture procedure) 1-3, and 4-5 is carried out respectively at homogeneity, and it adds, agitating 1-3 to 4-5, and the target lotion 3 is obtained. (Result) The lotion 3 obtained in the work example 5 was excellent in transparency, and showed good stability with the passage of time. On the other hand, in the comparative example 3, it could not dissolve or distribute uniformly, and the lotion excellent in transparency was not able to be obtained.

[0023] Example 4 [ lotion 4 component name ] A comparative example 4 Work example 6  
Tocopheryl potassium phosphate 0.10 0.102 Propylene Glycol - 1.003 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl 0.20 0.204 Spice 0.05 0.055 Purified water 99.65 The distributed dissolution of 98.65(manufacture procedure) 1 - 4 is carried out uniformly, and it adds, agitating 1-4 to 5, and the target lotion 4 is obtained. (Result) The lotion 4 obtained in the work example 6 was excellent in transparency, and showed good stability with the passage of time. On the other hand, in the comparative example 4, it could not dissolve or distribute uniformly, and the lotion excellent in transparency was not able to be obtained.

[0024] Example 5 [ emulsion 1 component name ] A comparative example 5 Work example 7  
Monostearin acid polyoxyethylene (20) sorbitan 1.00 1.002 Monostearin Acid Sorbitan 1.00 1.003 Squalane 10.00 10.004 Spice 0.05 0.055 Tocopheryl Sodium Phosphate 2.00 2.006 1,3-Butylene Glycol - 6.007 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl 0.20 0.208 Dipotassium Glycyrrhizinate - 0.509 Purified Water = 85.75 Carry out the distributed dissolution of 79.25 (manufacture procedure) 1-4, 5-7, and 8-9 respectively at homogeneity, add, agitating 5-7, and 8-9 to 1-4, and obtain the target emulsion 1. (Result) The emulsion 1 obtained in the work example 7 has the using feeling carried out gently, and showed good stability with the passage of time. On the other hand, although the emulsion was obtained in comparison 5, phase separation was observed several days afterward, and good stability with the passage of time was not able to be acquired.

[0025] Example 6 [cream 1 component name] A comparative example 6 Work example 81  
Mono-lauric acid decaglyceryl 1.00 1.002 Monostearin Acid Polyoxyethylene (15) Glyceryl 1.00  
1.003 Behenyl Alcohol 2.00 2.004 Squalane 12.00 12.005 Spice 0.05 0.056 Tocopheryl  
Sodium Phosphate 2.00 2.007 Dipropylene Glycol - 3.008 Para Hydroxybenzoic Acid Methyl  
0.20 0.209 ASUKORUBIN= Acid sodium phosphate - 3.0010 Purified Water 80.25 74.2511  
Carboxyvinyl Polymer 0.50 0.5012 Triethanolamine 1.00 The distributed dissolution of 1.00  
(manufacture procedure) 1-5, 6-8, and 9-12 is carried out respectively at homogeneity, and it  
adds, agitating 6-8, and 9-12 to 1-5, and target cream 1 is obtained. (Result) The cream 1  
obtained in the work example 8 has the using feeling carried out gently, and showed good  
stability with the passage of time. On the other hand, although cream was obtained in the  
comparative example 6, phase separation was observed several days afterward, and good  
stability with the passage of time was not able to be acquired.

[Translation done.]

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公報番号

特開平11-199465

(43)公開日 平成11年(1999)7月27日

(51)Int.Cl.  
A 61 K 7/48  
7/00

識別記号

F 1  
A 61 K 7/48  
7/00

H  
E  
C  
B

審査請求 未請求 請求項の数 4 FD (全 8 頁)

(21)出願番号 特願平10-13287

(71)出願人 000249908

(22)出願日 平成10年(1998)1月7日

有限公司野々川商事  
愛知県名古屋市中区丸の内3丁目5番24号

(72)発明者 八代 淳一  
愛知県名古屋市西区鳥見町2-7 日本メ

ナード化粧品株式会社総合研究所内

(72)発明者 小島 英頼

愛知県名古屋市西区鳥見町2-7 日本メ

ナード化粧品株式会社総合研究所内

(72)発明者 中田 俗

愛知県名古屋市西区鳥見町2-7 日本メ

ナード化粧品株式会社総合研究所内

(54)【発明の名称】 皮膚外用剤

(57)【要約】

【課題】トコフェリルリン酸エステルおよび/またはその塗類を安定に配合した皮膚外用剤を提供すること。

【解決手段】トコフェリルリン酸エステルおよび/またはその塗類と、多価アルコールおよび/またはある種の醇および/またはその塗類を同一系に配合することを特徴とする皮膚外用剤。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】トコフェリルリン酸エステルおよび/またはその塩類を配合し、かつ多価アルコールおよび/または酸および/またはその塩類を配合することを特徴とする皮膚外用剤。

【請求項2】界面活性剤を配合することを特徴とする【請求項1】の皮膚外用剤。

【請求項3】トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類、酸および/または塩類の配合量が、それぞれ0.01~30%、0.01~30%であることを特徴とする【請求項1】の皮膚外用剤。

【請求項4】トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類がナトリウム塩またはジナトリウム塩であり、多価アルコールがプロピレングリコールであり、酸および/またはその塩類がリン酸のカリウム塩またはアスコルビン酸またはその誘導体であることを特徴とする【請求項1】または

【請求項3】の皮膚外用剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類を安定に配合することを特徴とする皮膚外用剤に関する。

【0002】

【従来の技術】トコフェロールはビタミンEとして広く認知されており、高い抗酸化能、血行促進作用等の生理活性を有しており、古くから医薬品、化粧品、飼料等に配合されている。また、その誘導体であるトコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類は生体において代謝されることにより、トコフェロールと同等またはそれ以上の生物学活性を示すことがあり、今後もその利用価値は大きくなると思われる。

【0003】

【本発明が解決しようとする課題】しかし従来、トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類は、トコフェロールと比較して高い水溶性を示すものの、水溶液または乳化系に配合する際に凝聚沈殿等を起こし、安定に配合することが非常に困難であった。本発明はこのような課題を解決して、安定性および安全性の高い組成物を提供することを目的とする。

【0004】

【問題を解決するための手段】本発明者らは、これらの諸問題に対し検討した結果、溶液系または乳化系にトコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類を安定に配合できる手段を見出し、本発明を完成するにいたった。

【0005】すなわち、溶液系または乳化系において、トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類を、多価アルコールおよび/またはある種の酸および/またはその塩類と同一系に配合することにより、トコ

フェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類を安定に配合することを可能としたのである。また、溶液中や、安全性の高い界面活性剤を用いた乳化系において、トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類を併用した皮膚外用剤を調整すると、安全性の高い製剤を得ることができる。

【0006】本発明で用いられるトコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類は何でも良いが、好ましくはモノエステル、塩はナトリウム塩、ジナトリウム塩、カリウム塩、ジカリウム塩等の金属塩が良い。トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類の配合量は特に限定されないが0.01~20重量%が好ましい。さらに好ましくは0.01~5.0重量%である。0.01重量%以下では効果の発現が乏しく、20重量%以上では製剤上の安定性に不安がある。

【0007】本発明で用いられる多価アルコールは皮膚外用剤として使用できるものであれば何でも良いが、プロピレングリコールをはじめとしてジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、グリセリン、ジグリセリン、ポリグリセリン、ポリエチレングリコール等があげられる。さらに好ましくはプロピレングリコールである。多価アルコールの配合量は特に限定されないが0.01~99重量%の広範囲において適応が可能である。

【0008】本発明で用いられる酸および/またはその塩類は皮膚外用剤として使用できるものであれば何でも良いが、好ましくは、クエン酸、クエン酸塩、リン酸、リン酸塩、グリチルリチン酸、グリチルリチン酸塩、コハク酸、コハク酸塩、フル酸、フル酸塩、アスコルビン酸リン酸、アスコルビン酸リン酸塩等が好ましい。さらにその塩の種類としては、ナトリウム塩、ジナトリウム塩、カリウム塩、ジカリウム塩、マグネシウム塩等の金属塩が好ましい。これらの酸および/またはその塩類の配合量は特に限定されないが0.01~30重量%が好ましい。さらに好ましくは0.05~10重量%である。0.01重量%以下では効果の発現が乏しく、30重量%以上では製剤上の安定性に不安がある。

【0009】トコフェリルリン酸エ斯特ルおよび/またはその塩類は、多価アルコールおよび酸および/またはその塩類と同一系に使用すると、経時安定性がさらに良くなる。

【0010】また、本発明の皮膚外用剤には、本発明の効果を損なわない範囲で、化粧水、乳剤、クリーム、軟膏等に用いることができる。本発明の皮膚外用剤組成物は上記必須成分の他には一般に皮膚外用剤に用いられる成分であれば何でも良い。主要構成成分としては界面活性剤および/または油性物質および/または水性物質から成る。

【0011】本発明の皮膚外用剤組成物のひとつとして界面活性剤があげられる。本発明と組み合わせて使用で

きる界面活性物質は、一分子中に疎水部と親水部を有する物質であって、具体的には、乳化型化粧料に通常用いられている非イオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤、カチオン性界面活性剤、両性界面活性剤、及び両親性物質等が挙げられる。

【0012】非イオン界面活性剤としては、例えば、モノオレイン酸ソルビタン、モノイソステアリン酸ソルビタン、モノラクチル酸ソルビタン、モノパルミチン酸ソルビタン、モノステアリン酸ソルビタン、セスキオレイン酸ソルビタン、トリオレイン酸ソルビタン、ベンタ-2-エチルヘキシル酸ジグリセロールソルビタン、テトラ-2-エチルヘキシル酸ジグリセロールソルビタン等のソルビタン脂肪酸エステル類；モノステアリン酸グリセリルヤシ油脂肪酸グリセリル、オレイン酸グリセリル、ジステアリン酸グリセリル等のグリセリン脂肪酸エステル、モノオレイン酸ジグリセリル、モノイソステアリン酸ジグリセリル、モノステアリン酸デカグリセリル、モノオレイン酸デカグリセリル、モノステアリン酸ヘキサグリセリル等のポリグリセリン脂肪酸エステル；モノステアリン酸プロピレングリコール等のプロピレングリコール脂肪酸エステル類；ステアリン酸メチルグリコシド、ステアリン酸エチルグリコシド、ステアリン酸ブロビルグルコシド、オレイン酸メチルグルコシド等の脂肪酸アルキルグルコシド；硬化ヒマシ油誘導体；グリセリンアルキルエーテル；PEOソルビタンモノオレート、PEO-ソルビタンモノステアレート、PEO-ソルビタンモノオレート、PEO-ソルビタンテトラオレエート等のPEOソルビタン脂肪酸エステル類；PEO-ソルビットモノラウレート、PEO-ソルビットモノオレエート、PEO-ソルビットモノステアレート等のPEOソルビット脂肪酸エステル類；PEO-グリセリンモノステアレート、PEO-グリセリンモノイソステアレート、PEO-グリセリントリイソステアレート等のPEOグリセリン脂肪酸エステル類；PEOモノオレエート、PEOジステアレート、PEOモノジオレエート、ジステアリン酸エチレンジグリコール等のPEO脂肪酸エステル類；PEOラウリルエーテル、PEOオレイルエーテル、PEOステアリルエーテル、PEOヘニルエーテル、PEO-オクチルドデシルエーテル、PEOコレスタンノールエーテル等のPEOアルキルエーテル類；PEOオクチルフェニルエーテル、PEO-ニルフェニルエーテル、PEOジノニルフェニルエーテル等のPEOアルキルフェニルエーテル類；PEO-POセチルエーテル、PEO-PO-デシルテトラデシルエーテル、PEO-PO-モノブチルエーテル、PEO-PO水添ラノリン、HDI-HDIグリセリンエーテル等のHDI-HDIアルキルエーテル類；テトロニック等のテトラHDI-テトラDHDエチレンジアミン混合物類；HDIヒマシ油、HDI硬化ヒマシ油、HDI硬化ヒマシ油モノイソステアレート、HDI硬化ヒマシ油トリイソステアレート、HDI硬化ヒマシ油

モノビログルタミン酸モノイソステアリン酸ジエステル、PEO硬化ヒマシ油マレイン酸等のPEO-マン油硬化ヒマシ油誘導体；PEOソルビットミツロウ等のPEOミツロウ・ラノリン誘導体；ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド、ラウリン酸モノエタノールアミド、脂肪酸イソプロパノールアミド等のアルカノールアミド；PEOプロピレングリコール脂肪酸エステル；PEOアルキルアミン；PEO脂肪酸アミド；ショ糖モノステアレート、ショ糖ジステアレート、ショ糖トリステアレート等のショ糖脂肪酸エステル；PEOノニルフェニルホルムアルデヒド結合物；アルキルエトキシジメチルアミノキシド；トリオレイルリン酸；ポリエーテル変性シリコーン、アルコール変性シリコーン、アミノ変性シリコーン等のシリコーン系界面活性剤等が挙げられる。

【0013】アニオン界面活性剤としては、例えば、セッケン用素地、ラウリン酸ナトリウム、パルミチン酸ナトリウム、ラウリン酸カリウム、ミリスチン酸カリウム、パルミチン酸カリウム、ステアリン酸カリウム等の脂肪酸セッケン；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸カリウム等の高級アルキル硫酸エステル塩；コール酸ナトリウム、デオキシコール酸ナトリウム等の胆汁酸塩；ステアロイル乳酸ナトリウム、インステアロイル乳酸ナトリウム等のアシル乳酸塩；アルキルPEOラウリル硫酸トリエタノールアミン、PEOラウリル硫酸ナトリウム等のアルキルエーテル硫酸エステル塩；ラウロイルサルコシンナトリウム等のN-アシルサルコシン酸；N-ミリストイル-N-メチルタウリニンナトリウム、ヤシ油脂肪酸メチルタウリドナトリウム、ラウリルメチルタウリドナトリウム等の高級脂肪酸アミドスルホン酸塩；PEOオレイルエーテルリン酸ナトリウム、PEOステアリルユーテルリン酸等のリン酸エステル塩；ジ-2-エチルヘキシルスルホン酸ナトリウム、モノラウロイルモノエタノールアミドボリオキシエチレンスルホン酸ナトリウム、ラウリルボリオキシエチレンスルホン酸塩；N-ラウロイルクルタミン酸モノナトリウム、N-ミリストイル-L-グルクミン酸モノナトリウム等のN-アシルグルクミン酸塩；硬化ヤシ油脂肪酸グリセリン硫酸ナトリウム等の高級脂肪酸エステル硫酸エステル塩；ロート油等の硫酸化油；PEOアルキルエーテルカルボン酸；PEOアルキルアリルユーテルカルボン酸塩；α-オレイン酸スルホン酸塩；高級脂肪酸エステルスルホン酸塩；二級アルコール硫酸エステル塩；高級脂肪酸アルキロールアミド硫酸エステル塩；ラウロイルモノエタノールアミドコハク酸ナトリウム；N-バーミルミストイルアスハラギン酸ジエタノールアミン；

カゼインナトリウム；スルホン酸変性シリコーン等のシリコーン系界面活性剤等が挙げられる。

【0014】カチオン界面活性剤としては、例えば、塩化ステアリルトリメチルアンモニウム、塩化ラウリルトリメチルアンモニウム等のアルキルトリメチルアンモニウム塩； 塩化ジステアリルジメチルアンモニウム等のジアルキルジメチルアンモニウム塩； 塩化ポリ(*N,N'*-ジメチル-3,5-メチレンビペリジニウム)、塩化セチルビリジニウム等のアルキルビリジニウム塩； アルキル四級アンモニウム塩； アルキルジメチルベンジルアンモニウム塩； アルキルイソキノリニウム塩； ジアルキルモリホニウム塩； PCEアルキルアミン； アルキルアミン塩； ポリアミン脂肪酸誘導体； アミルアルコール脂肪酸誘導体； 塩化ベンザルコニウム； 塩化ベニゼトニウム等である。

【0015】両性界面活性剤としては、例えば、アルキルグリシン塩； カルボキシメチルグリシン塩； *N*-アシルアミノエチル-*N*-2-ヒドロキシエチルグリシン塩； アルキルポリアミノポリカルボキシグリシン塩； アルキルアミノプロピオン酸塩； アルキルイミノジプロピオン酸塩； *N*-アシルアミノエチル-*N*-2-ヒドロキシエチルビオニオン酸塩； アルキルジメチルアミノ酢酸ベタイン； 脂肪酸アミドプロピルジメチルアミノ酢酸ベタイン； アルキルジヒドロキシエチルアミノ酢酸ベタイン； *N*-アルキル-*N,N*-ジメチルアンモニウム-*N*-プロピルスルホン酸塩； *N*-アルキル-*N,N*-ジメチルアンモニウム-*N*-(2-ヒドロキシプロピル)スルホン酸塩； *N*-脂肪酸アミドプロピル-*N,N*-ジメチルアンモニウム-*N*-(2-ヒドロキシプロピル)スルホン酸塩等が挙げられる。

【0016】両親性物質とは、1分子中に非極性基と極性基を有する物質を指し、一般的に非イオン界面活性剤、イオン性界面活性剤とは区別して分類されるもので、例えば、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、ベヘン(ベヘニン)酸、オレイン酸、12-ヒドロキシステアリン酸、ウンデシレン酸、トール酸、イソステアリン酸、リノール酸、リノレイン酸、エイコサヘンタエン酸(EPA)、ドコサヘキサエン酸(DHA)等の高級脂肪酸； ラウリルアルコール、セチルアルコール、ステアリルアルコール、ベヘニルアルコール、ミリスチルアルコール、オレイルアルコール、セトステアリルアルコール等の直鎖アルコール； モノステアリルグリセリンエーテル(バチルアルコール)、*n*-デシルテトラデシノール、ラノリンアルコール、コレステロール、フィトステロール、ヘキシルドデカノール、イソステアリルアルコール、オクチルドデカノール等の分枝アルコール等の高級脂肪族アルコール； モノグリセリド、クリセロールモノアルキルエーテル、モノアルキルアミン、及びステロール骨格を有する化合物(コレステロール、フィトステロール)； ジアシルエステル型グリセロリン脂質(ホスファチジルコ

リン、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルイノシトール、ホスファチジルセリン、ホスファチジン酸、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジルセリン等)とこれらの水溶添加物及び水酸化物； モニアシルエステル型グリセロリン脂質(リゾホスファチジルコリン、リゾホスファチジルエタノールアミン、リゾホスファチジルイノシトール等)とこれらの水溶添加物； ブラスマグロング； スフィンゴミエリン； 脂肪質(ガラクトシルセラミド、グルコシルセラミド、スルファチド、ガングリオンド等)； サボニン等がある。

【0017】本発明の皮膚外用剤に使用される油性物質としては、油脂、ロウ類、炭化水素油、エステル類、シリコーン油、フルオロシリコン油、バーフルオロポリエーテル油等、公知の皮膚化粧用油性物質であれば、どんなものでも良く、例えば、液体油脂としては、アボガド油、ツバキ油、タートル油、マカデミアナッツ油、トウモロコシ油、ミンク油、オリーブ油、ナタネ油、卵黄油、ゴマ油、バージン油、小麦胚芽油、ザンカ油、ヒマシ油、アマニ油、サフラワー油、緑茶油、エノ油、大豆油、落花生油、茶実油、カヤ油、コメヌカ油、シナギリ油、日本キリ油、ホホバ油、胚芽油、トリグリセリン、トリオクタノン酸グリセリン、トリインパルミチン酸グリセリン等がある。固体油脂としては、カカオ脂、ヤシ油、馬脂、硬化ヤシ油、バーム油、牛脂、羊脂、硬化牛脂、バーム核油、豚脂、牛骨脂、モクロウ核油、硬化油、牛脚脂、モクロウ、硬化ヒマシ油等がある。ロウ類としては、ミクロウ、カンデリラロウ、綿ロウ、カルナバロウ、ペイベリーロウ、イボクロウ、練ロウ、モンタンロウ、スカラウ、ラノリン、カボックロウ、酢酸ラノリン、液状ラノリン、サトウキビロウ、ラノリン脂肪酸イソプロピル、ラウリン酸ヘキシル、還元ラノリン、ショジョバロウ、硬質ラノリン、セラックロウ等がある。炭化水素油としては、流動パラフィン、オゾケライト、スクワラン、ブリスタン、パラフィン、セレン、スクワレン、ワセリン、マイクロクリスクリンワックス等がある。台成エステル油としては、ミリスチン酸イソプロピル、オクタノン酸セチル、ミリスチン酸オクチルドデシル、パルミチノン酸イソプロピル、ステアリン酸ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ミリスチン酸ミリスチル、オレイン酸デシル、ジメチルオクタノン酸ヘキシルデシル、乳酸セチル、乳酸ミリスチル、酢酸ラノリン、ステアリン酸イソセチル、イソステアリン酸イソセチル、ヒドロキシステアリン酸コレステリル、ジ-2-エチルヘキシル酸エチレングリコール、ジベンタエリスリトール脂肪酸エステル、モノイソステアリン酸-*N*-アルキルグリコール、ジカズブリン酸ネオベンチルグリコール、リンゴ酸ジイソステアリル、ジ-2-ヘプチルウニデカン酸グリセリン、トリ-2-エチルヘキサン酸トリメチロールブロバン、トリイソステアリン酸トリメチロールブロバン、テトラ-2-エチルヘキサン酸ベンケンエリスリトール、ト

7  
 リ2-エチルヘキサン酸グリセリル、トリイソステアリン酸トリメチロールプロパン、セチル2-エチルヘキサノエート、2-エチルヘキシルパルミテート、トリミリスチン酸グリセリン、トリ-2-ヘプチルウンデカン酸クリセライド、ヒマシ油脂肪酸メチルエステル、オレイン酸オイル、セトステアリルアルコール、アセトグリセライト、パルミチン酸2-ヘプチルウンデシル、アジピン酸ジソブチル、N-ラウロイル-L-グルタミン酸-2-オクチルドデシルエステル、アジピン酸ジ-2-ヘプチルウンデシル、エチルラウレート、セバチン酸ジ-2-エチルヘキシル、ミリスチン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-ヘキシルデシル、アジピン酸2-ヘキシルデシル、セバチン酸ジソブチル、コハク酸2-エチルヘキシル、酢酸エチル、酢酸ブチル、酢酸アミル、クエン酸トリエチル等がある。シリコーン油としては、例えば、ジメチルボリシロキサン、メチルフェニルボリシロキサン、メチルハイドロジンボリシロキサン等の鎖状ボリシロキサンなどの環状ボリシロキサン；  
 デカメチルボリシロキサン、ドデカメチルボリシロキサン、テトラメチルテトラハイドロジンボリシロキサンなどの環状ボリシロキサン；  
 3次元網目構造を形成しているシリコン樹脂、シリコンゴム等が油として挙げられる。

【0018】本発明の皮膚外用剤に使用される水性物質としては、本発明の効果を失わない範囲で、通常化粧料に用いられる各種原料を使用できる。例えば、低級アルコールとしては、エタノール、ブロバノール、イソブロバノール等がある。保湿剤として又水相の界面張力を下げる目的で使用する多価アルコールは、ポリエチレンリコール、プロピレンリコール、ジプロピレンリコール、1,3-ブチレンリコール、ヘキシレンリコール、グリセリン、ジグリセリン等がある。その他保湿剤としてソルビトール、キシリトール、マルトール、マルトース、D-マンニット、エリスリトール、トレハロース、水アメ、ブドウ糖、果糖、乳糖、コンドロイチン硫酸ナトリウム、ヒアルロン酸ナトリウム、アデノシンリシン酸ナトリウム、乳酸ナトリウム、ビロリドンカルボン酸塩、グルコサミン、シクロデキストリン等がある。水溶性高分子としては、アラビアゴム、トラガカント、ガラクタン、キヤロブガム、グアーナム、カラヤガム、カラギーナン、ベクチン、カンテン、クインシード(マルメロ)、デンプン(コメ、トウモロコシ、パレイショ、コムギ)、アルゲクロイド(褐藻エキス)、ローカストビーンガム等の植物系高分子； キサンタンガム、ジェランガム、デキストラン、サクシノグルカン、ブルラン等の微生物系高分子； コラーゲン、カゼイン、アルブミン、ゼラチン等の動物系高分子； カルボキシメチルデンプン、メチルヒドロキシプロビルデンプン等のデンプン系高分子； メチセルロース、ニトロセルロース、エチセルロース、メチルヒドロキシプロビルセルロース、ヒドロキシエチセルロース、セルロース硫酸ナトリウム、ヒドロキシプロビルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、結晶セルロース、セルロース末等のセルロース系高分子； アルギン酸ナトリウム、アルギン酸プロピレンジコールエステル等のアルギン酸系高分子； ポリビニルメチルエーテル、カルボキシビニルボリマー等のビニル系高分子； ポリオキシエチレン系高分子； ポリオキシエチレンポリオキシプロピレン共重合体系高分子； ポリアクリル酸ナトリウム、ポリエチルアクリレート、ポリアクリルアミド等のアクリル系高分子； ポリエチレンイミン； カチオンポリマー； ベントナイト、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、ラボナイト、ヘクトライト、無水ケイ酸等の無機系水溶性高分子が等がある。凝剤(遊離物、酸または塩基の塩型、エステル型も含む)としては、ビタミンA油、レチノール、パルミチン酸レチノール、酢酸レチノール、イノシット、塩酸ビリドキシン、ニコチン酸ベンジル、ニコチン酸アミド、ニコチン酸 dl- $\alpha$ -トコフェロール、アスコルビン酸リシン酸マグネシウム、ビタミンD<sub>2</sub> (エルゴカシフェロール)、ビタミンD<sub>3</sub>、dl- $\alpha$ -トコフェロール、酢酸dl- $\alpha$ -トコフェロール、バントテン酸、ビオチン等のビタミン類、エストラジオール、エチニルエストラジオール等のホルモン、アルギニン、アスパラギン酸、シスチン、システイン、メチオニン、セリン、ロイシン、トリプトファン等のアミノ酸、アラントイン、クリチルレチノール、アズレン等の抗炎症剤、アルブチン、アスコルビン酸マグネシウム、アスコルビン酸ナトリウム等の美白剤、酸化亜鉛、タンニン酸、ショウバシ等の收敛剤、L-メントール、カンフル等の清涼剤やイオウ、塩化リゾチーム、塩酸ビリド

30  
 31  
 32  
 33  
 34  
 35  
 36  
 37  
 38  
 39  
 40  
 41  
 42  
 43  
 44  
 45  
 46  
 47  
 48  
 49  
 50  
 キシン、アーオリザノール等がある。各種の抽出液としては、ドクタミエキス、オウバクエキス、メリロートエキス、オドリコソウエキス、カンゾウエキス、シャクヤクエキス、サボンソウエキス、ヘチマエキス、キナエキス、ユキノシタエキス、クララエキス、コウホネエキス、ウイキョウエキス、サクラソウエキス、バラエキス、ジオウエキス、レモンエキス、シコンエキス、アロエエキス、ショウワ根エキス、ユーカリエキス、スギナエキス、セージエキス、タイムエキス、茶エキス、海藻エキス、キューカンバーエキス、ショウジョエキス、キイチゴエキス、メリッサエキス、ニンジンエキス、キャロットエキス、マロニエエキス、モモエキス、桃葉エキス、グワエキス、ヤグリマギクエキス、ハマメリス抽出液、プラセンタエキス、胸腺抽出物、シルク抽出液等がある。その他、安息香酸塩、バラオキシ安息香酸エステル、サリチル酸、フェノキシエタノール等の防腐剤、 $\alpha$ -トコフェロール、ジチルヒドロキシトルエン等の酸化防止剤、アラニン、エデト酸ナトリウム塩、ポリリン酸ナトリウム、メクリン酸ナトリウム、リン酸等のキレート剤、安息香酸系紫外線吸収剤、アントラニル酸系紫外線吸収剤、サリチル酸系紫外線吸収剤、ケイ皮酸系紫

9  
 外桿吸収剤、ベンゾフェノン系禁外桿吸収剤、ウロカニン酸、ウロカニン酸エチル、2-フェニル-5-メチルベンゾキサゾール、2-(2'-ヒドロキシ-5'-メチルフェニル)ベンゾトリアゾール、4-tert-ブチル-4'-メトキシジベンゾイルメタン等禁外桿吸収剤、2-アミノ-2-メチル-1-ブロバノール、2-アミノ-2-メチル-1,3-ブロバンジオール、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、トリエタノールアミン、炭酸ナトリウム、乳酸、クエン酸、グリコール酸、コハク酸、酒石酸、dL-リンゴ酸、およびこれららの塩、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水10  
 素アンモニウム等のpH調整剤、体质顔料、着色顔料、光輝性顔料、有機顔料、疎水化処理粉体、親水化処理粉\*

\* 体、タール色素、油性ゲル化剤、香料、殺菌剤等を使用できる。これらはそれぞれ単独で用いても良いし、2種以上組み合わせて用いても良い。また、その他の配合成分に拘りても、上記の成分に限らず、通常皮膚外用剤に用いられている無機顔料、動物・植物抽出液、色素類、香料、粉体等の公知の成分を配合することができる。

【0019】

【実施例】本発明を実施例により詳細に説明するが、本発明は実施例に限定されるものではない。実施例中の配合量は重量%である。

【0020】

## 例1 ローション1

	比較例1	実施例1	実施例2	実施例3
1 トコフェリルリン酸ナトリウム	2.00	2.00	2.00	2.00
2 アセビレングリコール	—	6.00	—	6.00
3 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20	0.20	0.20
4 エタノール	5.00	5.00	0.05	0.05
5 香料	0.05	0.05	0.05	0.05
6 リン酸水素二カリウム	—	—	5.00	5.00
7 精製水	92.75	86.75	87.75	81.75

## (製造方法)

1~5および6~7を各々均一に分散溶解し、6~7に1~5を搅拌しながら添加し目的のローション1を得る。

## (結果)

経時安定性	比較例1	実施例1	実施例2	実施例3
40℃(1ヶ月)	×	○	○	◎
5℃(1ヶ月)	×	○	○	◎
冷冻(常温戻し3回)	×	○	○	◎

◎: 安定性が特に優れている

○: 安定性が優れている

×: 安定性が悪い

ローション1において、実施例1、実施例2、実施例3は透明性に優れ、良好な経時安定性を示した。そのなかでも特に実施例3は経時的な安定性が優れていた。これに対し、比較例1においては均一に溶解または分散する※

※ ことができず、透明性に優れたローションを得ることはできなかった。

【0021】

## 例2 ローション2

成分名	比較例2	実施例4
1 トコフェリルリン酸ナトリウム	5.00	5.00
2 グリセリン	—	20.00
3 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20
4 リン酸水素二ナトリウム	—	3.00
5 精製水	94.80	71.80

(製造方法) 1~3および4~5を各々均一に分散溶解し、4~5に1~3を搅拌しながら添加し目的のローション2を得る。

\* 比較例2においては均一に溶解または分散することができず、油滴の浮遊が確認され、透明性に優れたローションを得ることはできなかった。

【0022】

(結果) 実施例4において得られたローション2は透明性に優れ、良好な経時安定性を示した。これに対し、比★

## 例3 ローション3

成分名	比較例3	実施例5
-----	------	------

(7)

特開平11-199465

11

12

1 トコフェリルリン酸カリウム	0.50	0.50
2 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20
3 香料	0.05	0.05
4 リン酸水素二ナトリウム	—	1.00
5 精製水	99.25	98.25

(製造方法) 1~3および4~5を各々均一に分散溶解し、4~5に1~3を搅拌しながら添加し目的のローション3を得る。

(結果) 実施例5において得られたローション3は透明性に優れ、良好な経時安定性を示した。これに対し、比※10

## 例4 ローション4

成分名	比較例4	実施例6
1 トコフェリルリン酸カリウム	0.10	0.10
2 プロピレングリコール	—	1.00
3 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20
4 香料	0.05	0.05
5 精製水	99.65	98.65

(製造方法) 1~4を均一に分散溶解し、5に1~4を搅拌しながら添加し目的のローション4を得る。

(結果) 実施例6において得られたローション4は透明性に優れ、良好な経時安定性を示した。これに対し、比※10

## 例5 乳剤1

成分名	比較例5	実施例7
1 モノステアリン酸		
2 ポリオキシエチレン(20)フルビタン	1.00	1.00
3 モノステアリン酸ソルビタン	1.00	1.00
4 スクワラン	10.00	10.00
5 香料	0.05	0.05
6 トコフェリルリン酸ナトリウム	2.00	2.00
7 1, 3-ブチレングリコール	—	6.00
8 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20
9 グリチルリチン酸ジカリウム	—	0.50
5 精製水	85.75	79.25

(製造方法) 1~4, 5~7および8~9を各々均一に分散溶解し、1~4に5~7および8~9を搅拌しながら添加し目的の乳剤1を得る。

(結果) 実施例7において得られた乳剤1はしっかりと良い使用感を有し、良好な経時安定性を示した。これに★

## 例6 クリーム1

成分名	比較例6	実施例8
1 モノラウリン酸デカグリセリル	1.00	1.00
2 モノステアリン酸		
3 ポリオキシエチレン(15)グリセリル	1.00	1.00
4 ベヘニルアルコール	2.00	2.00
5 スクワラン	12.00	12.00
6 香料	0.05	0.05
7 トコフェリルリン酸ナトリウム	2.00	2.00
8 ジプロピレングリコール	—	3.00
9 バラヒドロキシ安息香酸メチル	0.20	0.20
9 アスコルビン酸リノ酸ナトリウム	—	4.00

★に対し、比較例においては乳剤は得られるが数日後に相分離が観察され、良好な経時安定性を得ることはできなかった。

(結果) 実施例7において得られた乳剤1はしっかりと良い使用感を有し、良好な経時安定性を示した。これに★

(8)

13  
 10 精製水  
 11 カルボキシビニルポリマー  
 12 トリエタノールアミン

(製造方法) 1~5, 6~8および9~12を各々均一に分散溶解し、1~5に6~8および9~12を搅拌しながら添加し目的のクリーム1を得る。  
 (結果) 実施例8において得られたクリーム1はしっと

特開平11-199465

14

80.25  
 0.50  
 1.00

74.25  
 0.50  
 1.00

りとした使用感を有し、良好な経時安定性を示した。これに対し、比較例6においてはクリームは得られるが数日後に相分離が観察され、良好な経時安定性を得ることはできなかった。